

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

REC'D 27 FEB 2006


PCT

WIPO

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055119	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/013615	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 01.12.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 03.12.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D239/56, C07D239/54		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt 7 Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in computerlesbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p>		
<p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Bescheids</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags 03.09.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 23.02.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Schuermacher, A Tel. +49 89 2399-7818	



Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
- ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*:

Beschreibung, Seiten

1-38 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-16 eingegangen am 03.09.2005 mit Schreiben vom 30.08.2005

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☒ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☒ Ansprüche: Nr. 7
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/013615

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung
Neuheit (N) Ja: Ansprüche 1-16
Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit (IS) Ja: Ansprüche 1-16
Nein: Ansprüche
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) Ja: Ansprüche: 1-16
Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Zu Punkt I

Grundlage des Bescheides

Der Anmelder hat in seinem Brief vom 30. August 2005 einen geänderten Anspruchssatz eingereicht :

In Anspruch 1 wurde das Merkmal "in Gegenwart von 1,8 bis 2,6 Äquivalenten Base pro Mol des Phenylthio(thio)cyanats der Formel II" zugefügt.

Basis für diese Änderung basiert auf S.17, Z.21 der ursprüngliche Offenbarung. Dieses Merkmal ist als wesentlich hingestellt worden für die Funktion der Erfindung unter Berücksichtigung der technischen Aufgabe, die sie lösen soll.

Anspruch 7 wurde gestrichen und bei den verbliebenen Ansprüchen wurden die Nummerierungen sowie Rückbezüge dementsprechend geändert.

Der Gegenstand der Anmeldung geht nicht über den Inhalt der Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinaus (Artikel 19(2) / Artikel 34(2)(b) PCT).

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:

- D1: DE 197 41 411 A1 (NOVARTIS AG, BASEL, CH) 26. März 1998
- D2: US-A-5 169 430 (STRUNK ET AL) 8. Dezember 1992
- D3: EP-A-0 545 206 (BAYER AG) 9. Juni 1993
- D4: WO 03/097589 A1 (BASF AG, GERMANY) 27. November 2003
- D5: WO 03/024221 A1 (BASF AG) 27. März 2003
- D6: WO 01/83459 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 8. November 2001
- D7: EP-A-0 831 091 (NOVARTIS AG) 25. März 1998
- D8: A. M. KAMAL EL-DEAN AND M.E.ABDEL-MONEAM: "synthesis of pyrimidines, thienopyrimidines and pyrazolopyrimidine" J. OF CHINESE CHEM. SOC., Bd. 49, 2002, Seiten 1057-1060, XP009046134

1. Neuheit, Artikel 33(2) PCT:

Die vorliegende Anmeldung offenbart ein Verfahren zur Herstellung von 3-Phenyl(thio)uracilen und 3-Phenyldithiouracilen durch Umsetzung eines Phenyliso(thio)cyanats II mit einem Enamin III.

Dokumente D1-D3, D7 und D8 beschreiben auch die Umsetzung eines Enamins mit einem Phenyliso(thio)cyanat zur Herstellung von 3-Phenyliso(thio)uracilen; es fehlt jedoch die Acylsulfonamidgruppe in der Phenyliso(thio)cyanat-Verbindung.

In den Ansprüchen 16 und 17 in D4 werden 3-Phenyl(thio)uracile und 3-Phenyldithiouracile hergestellt durch Umsetzung eines Sulfamidsäureamids mit einem 3-Uracil-benzoessäure-Derivat.

Dokumente D5 und D6 beschreiben ein Verfahren zur Herstellung von 3-Phenyliso(thio)uracilen und 3-Phenyldithiouracilen durch Substitution eines Halogenatoms durch einen Uracil-, Thiouracil oder Dithiouracilrest oder durch Umsetzung einer Anilinverbindung mit einem Oxazinon, gefolgt von der Alkylierung des erhaltenen 3-Phenyluracils.

Die Voraussetzungen des Artikels 33(2) PCT sind daher erfüllt.

2. Erfinderische Tätigkeit, Artikel 33(3) PCT:

Die technische Aufgabe, die in der vorliegenden Anmeldung zu lösen ist, kann darin gesehen werden, ein verbessertes Verfahren zur Darstellung von 3-Phenyl(thio)uracilen und 3-Phenyldithiouracilen zu entwickeln, welches eine hohe Ausbeute und hohe Reinheit erzielt und das gewünschte Produkt in einer einfachen und wirtschaftlichen Weise zugänglich macht. Es werden in D2 und D7 die Herstellung von 3-Phenyluracilen durch Umsetzung eines Phenylisocyanats mit einem Enamin beschrieben, wobei allerdings die Phenylisocyanat-Verbindung eine Sulfonamidgruppe anstelle der Acylsulfonamidgruppe trägt.

Der Fachmann würde daher, das aus D2(D7) bekannte Verfahren ohne weiteres auch bei der Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen anwenden und auf diese Weise ohne erfinderisches Zutun zu dem Verfahren gemäß dem Anspruch 1 gelangen.

Der Anmelder hat jedoch in seinem Brief vom 30. August 2005 in einem Versuchsbericht zeigen können, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen sowohl nach dem in D7 offenbarten Verfahren (in dem eine katalytischen Mengen an Base verwendet wird) als auch nach dem in D2 offenbarten Verfahren (äquimolarer Mengen an Base verwendet) nicht herstellbar sind.

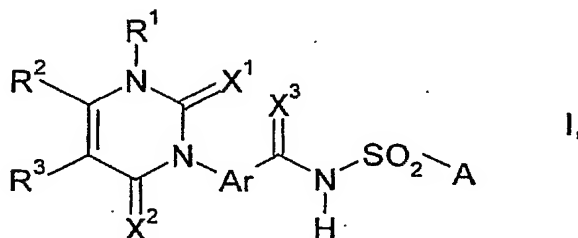
Während in D7 eine katalytische Menge an Base und in D2 eine nahezu äquimolarer Mengen an Base benutzt wird, wird in dem beanspruchten Verfahren einen großen Überschuß von 1,8 bis 2,6 Äquivalenten Base verwendet.

Weder in D7 noch in D2 gibt es ein Hinweis darauf, daß durch ein Überschuß an Base die gewünschten Phenyluracile hergestellt werden können.

Der Gegenstand des Anspruchs 1 kann als erfinderisch angesehen werden, da gezeigt worden ist, daß das beanspruchte Verfahren, in dem einen entsprechenden großen Überschuß von 1,8 bis 2,6 Äquivalenten Base verwendet wird, überraschender Weise zu den erfindungsgemäßen Verbindungen führt im Gegensatz zu den Verfahren aus D2 oder D7.

Patentansprüche

1. Verfahren zur Herstellung von 3-Phenyl(thio)uracilen oder 3-Phenyldithiouracilen der Formel I



worin die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:

R^1 Wasserstoff, Cyano, Amino, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_3 -Cyanoalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_3 - C_7 -Cycloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_3 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_6 -Halogenalkynyl oder Phenyl- C_1 - C_4 -alkyl;

R^2 und R^3 unabhängig voneinander

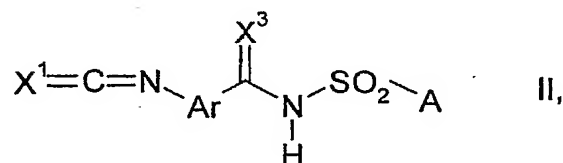
Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_3 - C_7 -Cycloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_3 - C_6 -Alkynyl oder C_3 - C_6 -Halogenalkynyl;

X^1 , X^2 und X^3 unabhängig voneinander Sauerstoff oder Schwefel;

Ar Phenyl, das durch folgende Gruppen ein- oder mehrfach substituiert sein kann: Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl; und

A ein von einem primären oder sekundären Amin abgeleiteter Rest oder NH_2 ;

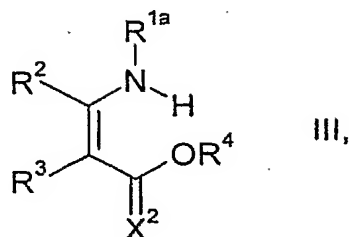
umfassend die Umsetzung eines Phenyliso(thio)cyanats der Formel II



worin die Variablen X^1 , X^3 , Ar und A die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen,

40

mit einem Enamin der Formel III



worin

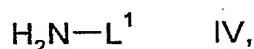
R^{1a} die zuvor für R^1 genannten Bedeutungen mit Ausnahme von Amino aufweist;

R^2 , R^3 und X^2 die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen; und

R^4 für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_1 - C_3 -Alkthio- C_1 - C_3 -alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_3 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_6 -Halogenalkynyl, C_3 - C_7 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Cyanoalkyl oder Benzyl, das seinerseits unsubstituiert oder am Phenylring durch Methyl, Methoxy, Methylthio, Halogen, Nitro oder Cyano substituiert ist, steht;

in Gegenwart von 1,8 bis 2,6 Äquivalenten Base pro Mol des Phenyliso(thio)-cyanates der Formel II;

und gegebenenfalls in einem weiteren Schritt die Umsetzung des erhaltenen 3-Phenyl(thio)uracils oder 3-Phenyldithiouracils der Formel I mit $R^1=R^{1a}$, wenn R^1 für Wasserstoff steht, mit einem Aminierungsmittel der Formel IV



wobei L^1 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht,

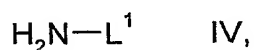
zu 3-Phenyl(thio)uracilen oder 3-Phenyldithiouracilen der Formel I mit R^1 =Amino.

2. Verfahren nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass die Umsetzung in Gegenwart einer Base erfolgt, die ausgewählt ist unter Alkali- und Erdalkalicarbonaten, Alkali- und Erdalkalimetallalkoholaten, Alkali- und Erdalkalihydriden und tertiären Aminen.

41

3. Verfahren nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass die Umsetzung in wenigstens einem aprotischen, polaren Lösungsmittel erfolgt, und das aprotische, polare Lösungsmittel einen Wassergehalt von 0 bis 0,5 Gew.-%, bezogen auf die Gesamtmenge an Verbindung II, Verbindung III und Lösungsmittel, aufweist.
4. Verfahren nach Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, dass das Lösungsmittel wenigstens 50 Vol.-% eines aprotischen polaren Lösungsmittels ausgewählt unter Carbonsäureamiden, Carbonsäureestern, Carbonaten, Nitrilen und Sulfoxiden umfasst.
5. Verfahren nach Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, dass das Lösungsmittel wenigstens 80 Gew.-% eines aprotischen polaren Lösungsmittels umfasst.
6. Verfahren nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass man pro Mol der Verbindung II 0,9 bis 1,3 Mol des Enamins der Formel III einsetzt.
7. Verfahren nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass man ein 3-Phenyl(thio)uracil oder ein 3-Phenyldithiouracil bereitstellt, worin R^1 gleich Wasserstoff ist, und diese Verbindung I anschließend

(A) mit einem Aminierungsmittel der Formel IV

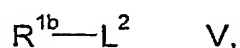


worin L^1 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, umgesetzt, wobei man eine Verbindung der Formel I erhält, worin

R^1 für Amino steht; und

die Variablen R^2 , R^3 , X^1 , X^2 , X^3 , Ar und A die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen; oder

(B) mit einem Alkylierungsmittel der Formel V



worin

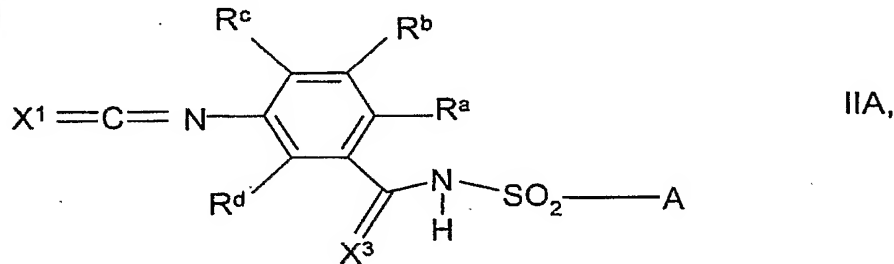
R^{1b} C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_3 - C_7 -Cycloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_3 - C_6 -Alkinyl oder C_3 - C_6 -Halogenalkinyl; und

L^2 eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe;

bedeutet;

umsetzt, wobei man eine Verbindung der allgemeinen Formel I erhält, worin R^1 die für R^{1b} genannten Bedeutungen hat; und die Variablen R^2 , R^3 , X^1 , X^2 , X^3 , Ar und A die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen.

8. Verfahren nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass das Phenyliso(thio)cyanat der Formel II durch die Formel IIA beschrieben wird



worin

X^1 , X^3 und A die zuvor genannte Bedeutung aufweisen und R^a , R^b , R^c und R^d jeweils unabhängig voneinander

Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl bedeuten.

9. Verfahren nach Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, dass in Formel IIA R^a Halogen, Cyano oder Trifluormethyl; R^c Wasserstoff oder Halogen; und R^b und R^d Wasserstoff bedeuten.
10. Verfahren nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass der Rest A für $-NR^5R^6$ steht, worin die Variablen R^5 und R^6 die folgenden Bedeutungen haben:

R^5 und R^6 unabhängig voneinander

Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl oder C_2 - C_{10} -Alkinyl, die unsubstituiert oder durch einen der folgenden Reste substituiert sein können:

C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, CN, NO_2 , Formyl, C_1 - C_4 -Alkylcarbonyl, C_1 - C_4 -Alkoxy carbonyl, C_1 - C_4 -Alkylaminocarbonyl, C_1 - C_4 -Dialkylaminocarbonyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, 3- bis 8-gliedriges Heterocycl mit ein bis drei Heteroatomen ausgewählt unter O, S, N und einer Gruppe NR^7

43

worin R^7 für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl oder C_3 - C_6 -Alkynyl steht

Phenyl, das seinerseits 1, 2, 3 oder 4 Substituenten, ausgewählt unter Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Fluoralkyl, C_1 - C_4 -Alkyloxycarbonyl, Trifluormethylsulfonyl, C_1 - C_3 -Alkylamino, C_1 - C_3 -Dialkylamino, Formyl, Nitro oder Cyano, aufweisen kann; C_1 - C_{10} -Halogenalkyl, C_2 - C_{10} -Halogenalkenyl, C_2 - C_{10} -Halogenalkynyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_{10} -Cycloalkenyl, 3- bis 8-gliedriges Heterocyclyl mit ein bis drei Heteroatomen, ausgewählt unter O, S, N und einer Gruppe

NR^7 , worin R^7 für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl oder C_3 - C_6 -Alkynyl steht,

Phenyl oder Naphthyl,

wobei C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_{10} -Cycloalkenyl, 3- bis 8-gliedriges Heterocyclyl, Phenyl oder Naphthyl ihrerseits durch 1, 2, 3 oder 4 Substituenten ausgewählt unter Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Fluoralkyl,

C_1 - C_4 -Alkyloxycarbonyl, Trifluormethylsulfonyl, Formyl, C_1 - C_3 -Alkylamino, C_1 - C_3 -Dialkylamino, Phenoxy, Nitro oder Cyano substituiert sein können, oder

R^5 und R^6 bilden gemeinsam einen gesättigten oder teilweise ungesättigten 5- bis 8-gliedrigen Stickstoffheterocyclus, der ein oder zwei Carbonylgruppen, Thiocarbonylgruppen und/oder ein oder zwei weitere Heteroatome, ausgewählt unter O, S, N und einer Gruppe NR^7 ,

worin R^7 für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl oder C_3 - C_6 -Alkynyl steht,

als Ringglieder aufweisen kann; und der

durch C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy und/oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl substituiert sein kann.

11. Verfahren nach Anspruch 10, dadurch gekennzeichnet, dass R^5 und R^6 die folgenden Bedeutungen haben:

R^5 und R^6 unabhängig voneinander

Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, das gegebenenfalls einen Substituenten ausgewählt aus der Gruppe Halogen, Cyano, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkyloxycarbonyl, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, Furyl, Thienyl, 1,3-Dioxolanyl und Phenyl,

das seinerseits gegebenenfalls durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiert sein kann, tragen kann;

C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl oder Phenyl, das gegebenenfalls 1

44

oder 2 Substituenten, ausgewählt aus der Gruppe Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Fluoralkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Nitro und C₁-C₃-Dialkylamino tragen kann;

Naphthyl oder Pyridyl; oder

- 5 R⁵ und R⁶ bilden zusammen einen fünf-, sechs- oder siebengliedrigen gesättigten oder ungesättigten Stickstoffheterocyclus, der ein weiteres Heteroatom ausgewählt unter N, O, und einer Gruppe NR⁷,

wobei R⁷ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkynyl steht;

- 10 als Ringglied enthalten kann, und/oder durch ein, zwei oder drei Substituenten ausgewählt unter C₁-C₄-Alkyl und C₁-C₄-Halogenalkyl substituiert sein kann.

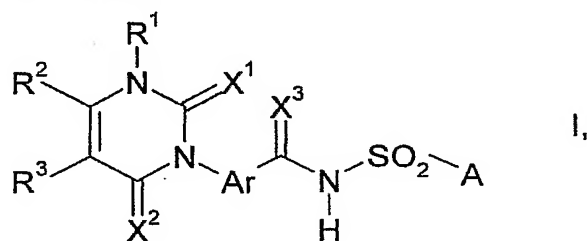
12. Verfahren nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass 15 X¹, X² und X³ jeweils für Sauerstoff stehen.

13. Verfahren nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass R¹ für Wasserstoff, Amino oder C₁-C₄-Alkyl steht.

- 20 14. Verfahren nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass R² für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl steht.

15. Verfahren nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass R³ für Wasserstoff steht.

- 25 16. Verfahren zur Herstellung von 3-Phenyl(thio)uracilen oder 3-Phenyldithiouracilen der Formel I,



- 30 wobei

R¹ C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Alkynyl oder C₃-C₆-Halogenalkynyl;

R² und R³ unabhängig voneinander

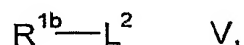
45

Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Alkynyl oder C₃-C₆-Halogenalkynyl; X¹, X² und X³ unabhängig voneinander Sauerstoff oder Schwefel;

Ar Phenyl, das durch folgende Gruppen ein- oder mehrfach substituiert sein kann: Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl; und

A ein von einem primären oder sekundären Amin abgeleiteter Rest oder NH₂; bedeutet,

dadurch gekennzeichnet, dass 3-Phenyl(thio)uracile oder 3-Phenyldithiouracile der Formel I, wobei R¹ für Wasserstoff steht, mit einem Alkylierungsmittel der Formel V



wobei L² für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, und

R^{1b} C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Alkynyl oder C₃-C₆-Halogenalkynyl bedeutet,

umgesetzt werden.